

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 06-157915

(43)Date of publication of application : 07.06.1994

---

(51)Int.Cl.

C08L 89/04  
// (C08L 89/04  
C08L 29:14  
C08L 71:02 )

---

(21)Application number : 04-319582

(71)Applicant : WARNER LAMBERT KK

(22)Date of filing : 30.11.1992

(72)Inventor : KOKUBU TOSHIO

ONUKI HIROSHI

SHIMIZU TOYOICHI

---

(54) HARD COATING FILM COMPOSITION FOR CAPSULE

(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain the subject composition useful for medicine, etc., not becoming brittle even in reduction of water content of coating film, having excellent flexibility, preventing leakage of medicinal agent by blending gelatin with given amounts of polyvinyl acetal diethyl aminoacetate and a polyethylene glycol.

CONSTITUTION: (A) Gelatin is mixed with (B) 1-10wt.% polyvinyl acetal diethyl aminoacetate and (C) 1-10wt.% polyethylene glycol (preferably 4,000 molecular weight) to give the objective composition.

---

### LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 29.11.1999

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number] 3320802

[Date of registration] 21.06.2002

[Number of appeal against examiner's  
decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's  
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-157915

(43)公開日 平成6年(1994)6月7日

(51)Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 8 L 89/04	L S E	7415-4 J		
// (C 0 8 L 89/04				
29: 14				
71: 02)				

審査請求 未請求 請求項の数1(全 4 頁)

(21)出願番号	特願平4-319582	(71)出願人	592084532 ワーナー・ランバート株式会社 東京都港区白金台3丁目19番1号
(22)出願日	平成4年(1992)11月30日	(72)発明者	国分 敏夫 神奈川県相模原市南橋本4-3-36 ワー ナー・ランバート株式会社カプスゲル事業 本部内
		(72)発明者	大貫 博 神奈川県相模原市南橋本4-3-36 ワー ナー・ランバート株式会社カプスゲル事業 本部内
		(74)代理人	弁理士 津国 肇 (外2名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 カプセル硬皮膜組成物

(57)【要約】

【構成】 ゼラチンに対し、ポリビニールアセタールジエチルアミノアセテート1～10重量%及びポリエチレングリコール1～10重量%を含有するカプセル硬皮膜組成物。

【効果】 吸湿性の薬剤を充填し、カプセル皮膜の水分量が低下したとしても脆弱化せず、カプセルにヒビ、欠け等が生じることが極めて少なく、カプセルの破損による内容薬剤の漏出を防止することができる。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】ゼラチンに対し、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート1～10重量%及びポリエチレングリコール1～10重量%を含有するカプセル硬皮膜組成物。

## 【発明の詳細な説明】

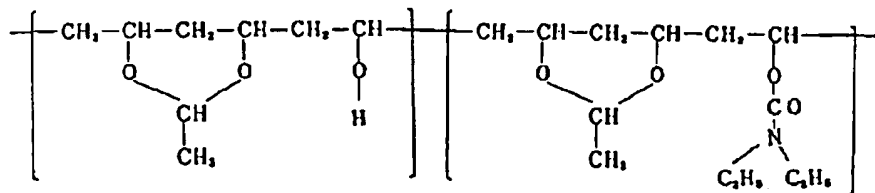
【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、硬ゼラチンカプセルやそのバンドシールに用いるカプセル硬皮膜組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】硬ゼラチンカプセルは、製剤化が容易であり、また服用がし易いことから、広く医薬品分野で用いられている。しかしながら、従来の硬ゼラチンカプセルは、粉末、顆粒等の吸湿性薬剤を充填すると、カプセル皮膜に含有する水分が薬剤に吸収されてカプセル皮膜の柔軟性が失われ、ヒビや割れが発生するという問題があった。特にカプセルに薬剤を充填した後の包装時や、服用時にカプセルを包材から取り出すときに、カプセルが破損し、内容薬剤がカプセルから漏出するという問題があった。

【0003】また、ゼラチンに、グリセリン、ソルビトール、ポリエチレングリコール等の可塑剤を添加し、柔軟性をもたせた硬ゼラチンカプセル硬皮膜組成物が知ら\*



【0008】で示される構成単位を有する高分子化合物である。中でも、アセタール化度58～68%、粘度(10%メタノール溶液を、25±0.1℃で測定)が9.0～16.0センチポアズのものが好ましい。市販品としては、胃溶性錠剤コーティング剤として知られるAEA三共〔三共(株)製〕を用いることができる。ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートの配合量は、ゼラチンに対し1～10重量%である。

【0009】本発明に用いるポリエチレングリコールとしては、日本薬局方又は日本薬局方外医薬品成分規格に記載されているものであれば特に制限はないが、中でも好ましいのは、ポリエチレングリコール4000である。ポリエチレングリコールの配合量は、ゼラチンに対し1～10重量%である。また、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートとポリエチレングリコールとの配合量の組合せは、ゼラチンに対しそれぞれ5重量%含有するのが最も好ましい。

【0010】本発明のカプセル硬皮膜組成物の製造方法としては、ゼラチンとポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートとポリエチレングリコールとを上記所

\*れている。しかしながら、これらの硬ゼラチンカプセルは、可塑剤の添加量によりカプセル皮膜が柔らかくなり過ぎたり、乾燥速度が遅い等、カプセル製造時に問題があった。したがって、従来の硬ゼラチンカプセルは、水分低下によるカプセル皮膜の脆弱化のため、充填する薬剤が制限されているのが現実である。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、吸湿性の薬剤を充填し、カプセル皮膜の水分量が低下したとしても脆弱化せず、カプセルにヒビ、欠け等が生じることが極めて少なく、カプセルの破損による内容薬剤の漏出を防止することができるカプセル硬皮膜組成物を提供することにある。

【0005】

【課題を解決するための手段】本発明は、ゼラチンに対し、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート1～10重量%及びポリエチレングリコール1～10重量%を含有するカプセル硬皮膜組成物である。

【0006】以下、本発明を詳細に説明する。本発明に用いるポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートは、次式：

【0007】

【化1】

定量含有する水溶液を調製した後、これに酸化チタン、食用色素等の着色剤を添加し、粘度を調整し、カプセル製造機で成形する方法を挙げることができる。また、ゼラチンとポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートとポリエチレングリコールとを含有する水溶液を調製するに際しては、次の方法によるのが好ましい。

【0011】まず、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートを酸性水溶液に溶解する。ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートの濃度は、20～30重量%が好ましい。次に、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート水溶液のpHをゼラチンと同じ弱酸性(pH5～6)に調整する。次にゼラチン水溶液と混合する。この際、ポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート水溶液は高温でゲル化する性質があるため注意を要する。

【0012】混合方法としては、例えば、予め比較的低温でゼラチンとポリビニルアセタールジエチルアミノアセテートとの1：1混合液を調製しておき、この混合液をゼラチン溶液に添加する方法を挙げることができる。この混合液は温度を上げてゲル化しないので、操

作性が向上する。次に、ゼラチンとポリビニールアセタールジエチルアミノアセテートとを混合した溶液に、上記所定量のポリエチレングリコールを混合し、その他の所望の添加剤を混合し、粘度を調整してカプセル製造機に供給する組成物を得る。

【0013】

【実施例】

実施例1

ポリビニールアセタールジエチルアミノアセテート [AEA三共、三共(株)製] 600g を酸性溶液に溶解し、25重量%AEA水溶液を調製した。この溶液に水酸化ナトリウムを添加して、pHを5.7に調整した後、冷却して放置し、脱泡した。

【0014】このAEA水溶液と同量の34%重量ゼラチン水溶液を混合し、1:1AEA-ゼラチン混合液を調製した。次に、別途調製した34%重量ゼラチン水溶液に、上記の1:1AEA-ゼラチン混合液を、ゼラチンの総量に対しAEAが5重量%になるように混合した。これに、60℃に加熱した60重量%ポリエチレングリコール4000水溶液を、ゼラチンの総量に対し5重量%になるように混合した後、酸化チタン及び食用色素を添加して粘度を調整し、カプセル製造機に供給する組成物を得た。

\*【0015】この組成物を、カプセル製造機に供給し、カプセルを製造した。得られたカプセルについて、下記の空カプセル衝撃試験の結果を表1に、充填カプセル加圧試験を表2に、崩壊試験を表3に示す。

【0016】空カプセル衝撃試験

得られたカプセルについて、インパクト・テスター(カプセル社製)を使用し、カプセルの胴部を突破するときの、カプセルの厚さ当たりの仕事量(mJ/mm)を測定し、耐衝撃性について評価した。

【0017】充填カプセル加圧試験

得られたカプセルにコーンスターチを充填し、カプセルに5kgの荷重をかけたときに、カプセル50個中破損したカプセルの割合(%)で評価した。

【0018】崩壊試験

第十二改正日本薬局方に準拠し、乳糖を充填したカプセルを、37±2℃の蒸留水に浸漬し、カプセルの開口時間、内容物の放出完了時間及びカプセルの溶解完了時間で評価した。また、上記試験については、ゼラチンに対し5重量%のポリエチレングリコールを含む組成物からなるカプセル、及び従来品の試験結果を併記した。

【0019】

【表1】

空カプセル衝撃試験 (単位: mJ/mm)

カプセル水分 (%)	13%	11%	9%	8%
AEA+PEG	21.8	21.8	21.1	15.6
PEG	20.8	19.7	17.1	13.7
従来品	21.3	19.7	15.5	12.1

【0020】

※ ※【表2】

充填カプセル加圧試験 (単位: %)

カプセル水分 (%)	13%	11%	9%	7%
AEA+PEG	0	0	0	0
PEG	0	0	0	12
従来品	0	3	10	26

【0021】

【表3】

## 崩壊試験

カプセル水分	開口時間	内容物放出完了時間	溶解完了時間
AEA+PEG	42秒	1分18秒	8分46秒
PEG	37秒	1分27秒	8分48秒
従来品	36秒	1分10秒	9分18秒

【0022】表1及び表2から明らかなように、カプセル強度が、特に低水分領域において、従来品及びポリエチレングリコール添加品に比べ優れており、表3から明らかなように、崩壊性については、従来品と同等であり、日本薬局方に適合する。

【0023】

【発明の効果】本発明のカプセル硬皮膜組成物は、吸湿性の薬剤を充填し、カプセル皮膜の水分量が低下したとしても脆弱化せず、カプセルにヒビ、欠け等が生じることが極めて少なく、カプセルの破損による内容薬剤の漏出を防止することができる。

フロントページの続き

(72)発明者 清水 豊一

神奈川県相模原市南橋本4-3-36 ワー  
ナー・ランバート株式会社カプスゲル事業  
本部内